

Cosmetic or dermatological preparations containing cardiolipin, useful e.g. for treatment, care and prophylaxis of sensitive skin and treatment of inflammatory conditions such as eczema or psoriasis

Patent number: DE10131796

Publication date: 2003-01-16

Inventor: BLATT THOMAS (DE); SCHMIDT MELANIE (DE); SCHREINER VOLKER (DE); STAEB FRANZ (DE)

Applicant: BEIERSDORF AG (DE)

Classification:

- **international:** *A61K8/55; A61Q19/00; A61Q19/08; A61K8/30; A61Q19/00; A61Q19/08;* (IPC1-7): A61K7/48

- **european:** A61K8/55C; A61Q19/00; A61Q19/08

Application number: DE20011031796 20010630

Priority number(s): DE20011031796 20010630

[Report a data error here](#)

Abstract of DE10131796

The use of cardiolipin (I) is claimed in cosmetic or dermatological preparations (A) for the treatment, care and prophylaxis of sensitive skin and/or the treatment and prophylaxis of the symptoms of negative abnormalities in the physiological homeostasis of healthy skin. An Independent claim is also included for cosmetic or dermatological preparations containing (I).

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide



⑯ BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND



DEUTSCHES

PATENT- UND
MARKENAMT

⑯ **Offenlegungsschrift**
⑯ **DE 101 31 796 A 1**

⑯ Int. Cl.⁷:

A 61 K 7/48

DE 101 31 796 A 1

⑯ Aktenzeichen: 101 31 796.4
⑯ Anmeldetag: 30. 6. 2001
⑯ Offenlegungstag: 16. 1. 2003

⑯ Anmelder:
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

⑯ Erfinder:
Blatt, Thomas, Dr., 22559 Hamburg, DE; Schmidt, Melanie, 21031 Hamburg, DE; Schreiner, Volker, Dr., 20259 Hamburg, DE; Stäb, Franz, Dr., 21379 Echem, DE
⑯ Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht zu ziehende Druckschriften:

US 57 38 856 A
EP 04 74 270 B1
EP 03 96 184 B1
EP 03 42 620 B1
WO 91 08 735 A1

PARADIES, Giuseppe, et.al.: The effect of reactive oxygen species generated from the mitochondrial electron transport chain on the cytochrome c oxidase activity and on the cardiolipin content in bovine heart submitochondrial particles. In:

FEBS Letters 466, 2000, S.323-326;
PARADIES, Giuseppe, et.al.: Peroxidative damage to cardiac mitochondria: cytochrome oxidase and cardiolipin alterations. In: FEBS Letters 424, 1998, S.155-158;
PARADIES, Giuseppe, et.al.: Age-dependent decline in the cytochrome c oxidase activity in rat heart mitochondria: role of cardiolipin. In: FEBS Letters 406, 1997, S.136-138;
YAROSLAVOV, A.A., et.al.: DNA affinity to biological membranes is enhanced due to complexation with hydrophobized polycation. In: FEBS Letters 384, 1996, S.177-180;
Surfactant science series, Vol.68, Surfactants in cosmetics, 2.Aufl., edited by Martin M. Rieger, Linda, D. Rhein, 1997, Marcel Dekker, Inc., S.263-283;

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

⑯ Verwendung von Cardiolipin in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen

⑯ Verwendung von Cardiolipin in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung, Pflege und Prophylaxe von degenerativen Hauterscheinungen, sensibler Haut und/oder zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome einer negativen Veränderung der physiologischen Homeostase der gesunden Haut.

DE 101 31 796 A 1

DE 101 31 796 A 1

Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Cardiolipin in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Prophylaxe vor und Behandlung von degenerativen Hauterscheinungen, wie beispielsweise Falten und Fältchen, Haut- und Gewebeerschlaffung, Störungen in der Hautregeneration, Durchblutungsstörungen der Haut, sensible Haut, Juckreiz Stressemfindlichkeit sowie Veränderungen der DNS-Synthese- und/oder DNS-Reparaturleistung in der Haut.

[0002] Insbesondere betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an Cardiolipin z. B. zum Schutz vor schädlichen Oxidationsprozessen in der Haut.

[0003] Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

[0004] Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

[0005] Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

[0006] Die chronologische Hautalterung wird z. B. durch endogene, genetisch determinierte Faktoren verursacht. In Epidermis und Dermis kommt es alterungsbedingt z. B. zu folgenden Strukturschäden und Funktionsstörungen, die auch unter den Begriff "Senile Xerosis" fallen können wie:

- a) Trockenheit, Rauhigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen,
- b) Juckreiz und

25 c) verminderte Rückfettung durch Talgdrüsen (z. B. nach Waschen).

[0007] Exogene Faktoren, wie UV-Licht und chemische Noxen, können kumulativ wirksam sein. In Epidermis und Dermis kommt es insbesondere durch exogene Faktoren z. B. zu folgenden Strukturschäden- und Funktionsstörungen in der Haut:

30 d) vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit).

Produkte zur Pflege sensibler, juckender und/oder trockener Haut bzw. Produkte zur Behandlung von oder Prophylaxe vor DNS-Schädigungen sowie Produkte, welche beispielsweise die chronologische Hautalterung verlangsamen sollen, sind an sich bekannt. Allerdings ist deren Wirksamkeit begrenzt.

[0008] Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. In Abhängigkeit von ihrer jeweiligen Wellenlänge haben die Strahlen verschiedene Wirkungen auf das Organ Haut: Die sogenannte UV-C-Strahlung mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist, wird von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert und hat daher keine physiologische Bedeutung. Dagegen verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UV-B-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen. Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

[0009] Zum Schutz gegen UV-B-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich beispielsweise um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoësäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie des s-Triazins handelt.

[0010] Man hat lange Zeit fälschlicherweise angenommen, daß die langweilige UV-A-Strahlung mit einer Wellenlänge zwischen 320 nm und 400 nm nur eine vernachlässigbare biologische Wirkung aufweist. Inzwischen ist allerdings durch zahlreiche Studien belegt, daß UV-A-Strahlung im Hinblick auf die Auslösung photodynamischer, speziell phototoxischer Reaktionen und chronischer Veränderungen der Haut weitaus gefährlicher als UV-B-Strahlung ist. Auch kann der schädigende Einfluß der UV-B-Strahlung durch UV-A-Strahlung noch verstärkt werden.

[0011] So ist es u. a. erwiesen, daß selbst die UV-A-Strahlung unter ganz normalen Alltagsbedingungen ausreicht, um innerhalb kurzer Zeit die Collagen- und Elastinfasern zu schädigen, die für die Struktur und Festigkeit der Haut von wesentlicher Bedeutung sind. Hierdurch kommt es zu chronischen lichtbedingten Hautveränderungen – die Haut "altert" vorzeitig. Zum klinischen Erscheinungsbild der durch Licht gealterten Haut gehören beispielsweise Falten und Fältchen sowie ein unregelmäßiges, zerfurchtes Relief. Ferner können die von lichtbedingter Hautalterung betroffenen Partien eine unregelmäßige Pigmentierung aufweisen. Auch die Bildung von braunen Flecken, Keratosen und sogar Karzinomen bzw. malignen Melanomen ist möglich. Eine durch die alltägliche UV-Belastung vorzeitig gealterte Haut zeichnet sich außerdem durch eine geringere Aktivität der Langerhanszellen und eine leichte, chronische Entzündung aus.

[0012] Etwa 90% der auf die Erde gelangenden ultravioletten Strahlung besteht aus UV-A-Strahlen. Während die UV-B-Strahlung in Abhängigkeit von zahlreichen Faktoren stark variiert (z. B. Jahres- und Tageszeit oder Breitengrad), bleibt die UV-A-Strahlung unabhängig von Jahres- und tageszeitlichen oder geographischen Faktoren Tag für Tag relativ konstant. Gleichzeitig dringt der überwiegende Teil der UV-A-Strahlung in die lebende Epidermis ein, während etwa 70% der UV-B-Strahlen von der Hornschicht zurückgehalten werden.

[0013] Es ist daher von grundsätzlicher Wichtigkeit, daß kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen sowohl gegen UV-B- als auch gegen UV-A-Strahlung ausreichenden Schutz bieten.

[0014] UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen. Ferner zählt UV-Strahlung zur ionisierenden Strahlung. Es besteht also das Risiko, daß auch ionische Spezies bei UV-Exposition entstehen, welche dann ihrerseits oxidativ in die bioche-

mischen Prozesse einzugreifen vermögen.

[0015] Es ist darüber hinaus bekannt, daß in der menschlichen und tierischen Haut unerwünschte Oxidationsprozesse auftreten können. Im Aufsatz "Skin Diseases Associated with Oxidative Injury" in "Oxidative Stress in Dermatology", S. 323ff. (Marcel Decker Inc., New York, Basel, Hong Kong, Herausgeber: Jürgen Fuchs, Frankfurt, und Lester Packer, Berkeley/Californien), werden derartige oxidative Schäden der Haut und ihre näheren Ursachen aufgeführt. 5

[0016] Antioxidantien werden zwar hauptsächlich als Schutzsubstanzen gegen den Verderb der sie enthaltenden Zubereitungen verwendet. Allerdings können Antioxidantien und/oder Radikalfänger auch in kosmetischen bzw. dermatologischen Formulierungen eingesetzt werden, um Oxidationsreaktionen abzuhelfen bzw. vorzubeugen.

[0017] So ist bereits in den US-Patentschriften 4,144,325 und 4,248,861 sowie in zahlreichen anderen Dokumenten vorgeschlagen worden, Vitamin E – eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen – einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung weit hinter der erhofften zurück. 10

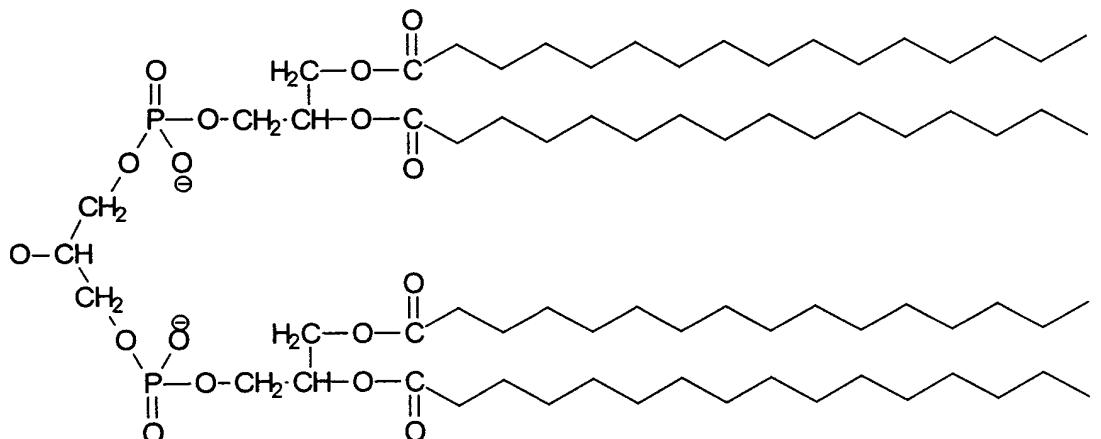
[0018] Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es daher, die Nachteile des Standes der Technik zu vermeiden und insbesondere die durch Umweltnoxen verursachten Schäden dauerhaft, nachhaltig und ohne das Risiko von Nebenwirkungen zu beheben bzw. ihnen vorzubeugen.

[0019] Weitere Aufgabe der Erfindung war es, kosmetische, dermatologische und pharmazeutische Wirkstoffe und Zubereitungen sowie Lichtschutzformulierungen zu schaffen, die zur Prophylaxe und Behandlung lichtempfindlicher Haut, insbesondere von Photodermatosen, bevorzugt der polymorphen Lichtdermatose dienen. 15

[0020] Weitere Bezeichnungen für die polymorphe Lichtdermatose sind PLD, PLE, Mallorca-Akne und eine Vielzahl von weiteren Bezeichnungen, wie sie in der Literatur (z. B. A. Voelkel et al. Zentralblatt Haut- und Geschlechtskrankheiten (1989), 156, S. 2), angegeben sind. 20

[0021] Es hat sich überraschenderweise herausgestellt, daß die Verwendung von Cardiolipin in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung, Pflege und Prophylaxe von degenerativen Hauterscheinungen, sensibler Haut und/oder zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome einer negativen Veränderung der physiologischen Homeostase der gesunden Haut den Nachteilen des Standes der Technik abhilft.

[0022] Cardiolipin ist ein in Mitochondrienmembranen vorkommendes Diphosphatidylglycerin, welches sich durch die folgende Strukturformel auszeichnet: 25



[0023] Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfindung 0,0005 bis 50 Gew.-%, bevorzugt 0,01 bis 20 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,01 bis 5 Gew.-% an Cardiolipin, jeweils bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen. 45

[0024] Bei Anwendung des erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffs bzw. kosmetischer oder topischer dermatologischer Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff ist in überraschender Weise eine wirksame Behandlung, aber auch eine Prophylaxe von 50

- Veränderungen der normalen Lipidperoxidation,
- defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Hautzuständen oder defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Zuständen von Hautanhängsgebilden,
- entzündlichen Hautzuständen,
- atopischem Ekzem, polymorpher Lichtdermatose, Psoriasis, Vitiligo
- empfindlicher, juckender oder gereizter Haut,
- Veränderung des Ceramid-, Lipid- und Energiestoffwechsels der gesunden Haut,
- Veränderung des physiologischen transepidermalen Wasserverlustes,
- Verminderung der Hauthydratation und Abnahme des Feuchtigkeitsgehaltes der Haut,
- Veränderung des Natural Moisturizing Factor Gehaltes,
- Verminderung der Zell-Zell-Kommunikation,
- Mängelscheinungen der intrazellulären DNS-Synthese,
- DNS-Schädigungen und Verminderung von endogenen DNS-Reparaturmechanismen,
- Aktivierung von Metalloproteinasen und/oder anderer Proteasen bzw. Inhibierung der entsprechenden endogenen Inhibitoren dieser Enzyme,
- Abweichungen von den normalen post-translationalen Modifikationen von Bindegewebsbestandteilen,
- Veränderungen des normalen Hyaluronsäure- und Glycosaminoglycangehaltes der gesunden Haut,

- Schuppenbildung der Haare,
- Hautbrüchigkeit und Hautermüdung,
- Erhöhung der normalen Keratinozytenproliferation,
- Verminderung der natürlichen Regeneration und Struktur der Haare,
- 5 – umweltbedingten (durch Rauchen, Smog, reaktive Sauerstoffspezies, freie Radikale verursachten) negativen Veränderungen der Haut und der Hautanhängsgebilde möglich.

[0025] Es ist erfundungsgemäß insbesondere äußerst vorteilhaft, den erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. kosmetische oder topische dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoff zur kosmetischen oder dermatologischen Behandlung oder Prophylaxe unerwünschter Hautzustände – wie beispielsweise Falten und/oder Fältchen, Haut- und Gewebeerschlaffung, Durchblutungsstörungen der Haut, sensible Haut, Juckreiz, Stressempfindlichkeit, entzündliche Hautzustände (atopisches Ekzem, Psoriasis etc.) und dergleichen – zu verwenden.

[0026] Gegenstand der Erfindung sind daher auch
15 kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an Cardiolipin.

[0027] Vorteilhaft kann der erfundungsgemäß verwendete Wirkstoff eingearbeitet werden in übliche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, welche in verschiedenen Formen vorliegen können. Die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können bevorzugt neben einer oder mehrerer Ölphasen (in welche das Cardiolipin vorzugsweise eingearbeitet wird) zusätzlich eine oder mehrere Wasserphasen enthalten und beispielsweise in Form von W/O-, O/W-,
20 multiplen (W/O/W-, O/W/O-)Emulsionen vorliegen. Solche Formulierungen können vorzugsweise auch eine Mikroemulsion, eine Feststoff-Emulsionen (d. h. eine Emulsion, welche durch Feststoffe stabilisiert ist, z. B. eine Pickering-Emulsion), eine sprühbare Emulsion, eine Hydrodispersion oder Lipodispersion sein.

[0028] Ferner kann der erfundungsgemäß verwendete Wirkstoff vorteilhaft in eine Lösung, ein Gel, einen festen Stift oder auch ein Aerosol eingearbeitet werden.

25 [0029] Bevorzugt stellen die erfundungsgemäßen Emulsionen O/W-Emulsionen dar.

[0030] Besonders vorteilhafte Zubereitungen werden ferner erhalten, wenn als Zusatz- oder weitere Wirkstoffe Antioxidantien eingesetzt werden. Erfundungsgemäß enthalten die Zubereitungen vorteilhaft eines oder mehrere Antioxidantien. Als günstige, aber dennoch fakultativ zu verwendende Antioxidantien können alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

30 [0031] Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximin, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxsäuren (z. B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A-palmitat) sowie Konyferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfundungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

50 [0032] Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung können wasserlösliche Antioxidantien eingesetzt werden, wie beispielsweise Vitamine, z. B. Ascorbinsäure und deren Derivate.

[0033] Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 bis 20 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

55 [0034] Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

[0035] Sofern Vitamin A bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das
60 Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

[0036] Erfundungsgemäß können weitere Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) auch sehr vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der lipophilen Wirkstoffe, insbesondere aus folgender Gruppe:

Acetylsalicylsäure, Atropin, Azulen, Hydrocortison und dessen Derivaten, z. B. Hydrocortison-17-valerat, Vitamine der B- und D-Reihe, sehr günstig das Vitamin B1, das Vitamin B12 das Vitamin D1, aber auch Bisabolol, ungesättigte Fettsäuren, namentlich die essentiellen Fettsäuren (oft auch Vitamin F genannt), insbesondere die gamma-Linolensäure, Ölsäure, Eicosapentaensäure, Docosahexaensäure und deren Derivate, Chloramphenicol, Coffein, Prostaglandine, Thymol, Campher, Extrakte oder andere Produkte pflanzlicher und tierischer Herkunft, z. B. Nachtkerzenöl, Borretschöl oder Johanniskernöl, Fischöle, Lebertran aber auch Ceramide und ceramidähnliche Verbindungen und so weiter.

DE 101 31 796 A 1

[0037] Vorteilhaft ist es auch, die weiteren Wirkstoffe aus der Gruppe der rückfettenden Substanzen zu wählen, beispielsweise Purcellinöl, Eucerin® und Neocerit®.

[0038] Besonders vorteilhaft werden der oder die weiteren Wirkstoffe ferner gewählt aus der Gruppe der NO-Synthasemänner, insbesondere wenn die erfundungsgemäßen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome der intrinsischen und/oder extrinsischen Hautalterung sowie zur Behandlung und Prophylaxe der schädlichen Auswirkungen ultravioletter Strahlung auf die Haut dienen sollen.

5

[0039] Bevorzugter NO-Synthasehemmer ist das Nitroarginin.

[0040] Weiter vorteilhaft werden der oder die weiteren Wirkstoffe gewählt aus der Gruppe, welche Catechine und Gallensäureester von Catechinen und wäßrige bzw. organische Extrakte aus Pflanzen oder Pflanzenteilen umfaßt, die einen Gehalt an Catechinen oder Gallensäureestern von Catechinen aufweisen, wie beispielsweise den Blättern der Pflanzenfamilie Theaceae, insbesondere der Spezies *Camellia sinensis* (grüner Tee). Insbesondere vorteilhaft sind deren typische Inhaltsstoffe (wie z. B. Polyphe nole bzw. Catechine, Coffein, Vitamine, Zucker, Mineralien, Aminosäuren, Lipide).

10

[0041] Catechine stellen eine Gruppe von Verbindungen dar, die als hydrierte Flavone oder Anthocyanidine aufzufassen sind und Derivate des "Catechins" (Catechol, 3,3',4',5,7-Flavanpentaol, 2-(3,4-Dihydroxyphenyl)-chroman-3,5,7-triol) darstellen. Auch Epicatechin ((2R,3R)-3,3',4',5,7-Flavanpentaol) ist ein vorteilhafter Wirkstoff im Sinne der vorliegenden Erfindung.

15

[0042] Vorteilhaft sind ferner pflanzliche Auszüge mit einem Gehalt an Catechinen, insbesondere Extrakte des grünen Tees, wie z. B. Extrakte aus Blättern der Pflanzen der Spezies *Camellia* spec., ganz besonders der Teesorten *Camellia* si-

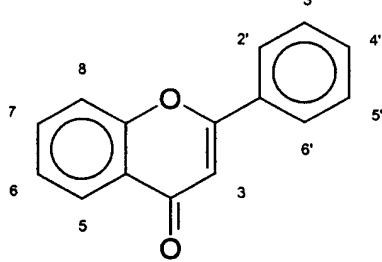
[0043] Besvorteigte weitere Wirkstoffe sind ferner Polyphenole bzw. Catechine aus der Gruppe (–)-Catechin, (+)-Catechin, (–)-Catechingallat, (–)-Galicocatechingallat, (+)-Epicatechin, (–)-Epicatechin, (–)-Epicatechin Gallat, (–)-Epigallocatechin, (–)-Epigallocatechingallat.

20

[0044] Auch Flavon und seine Derivate (oft auch kollektiv "Flavone" genannt) sind vorteilhafte weitere Wirkstoffe im Sinne der vorliegenden Erfindung. Sie sind durch folgende Grundstruktur gekennzeichnet (Substitutionspositionen angegeben):

gegeben).

25



30

35

[0045] Einige der wichtigeren Flavone, welche auch bevorzugt in erfindungsgemäßen Zubereitungen eingesetzt werden können, sind in der nachstehenden Tabelle aufgeführt:

40

45

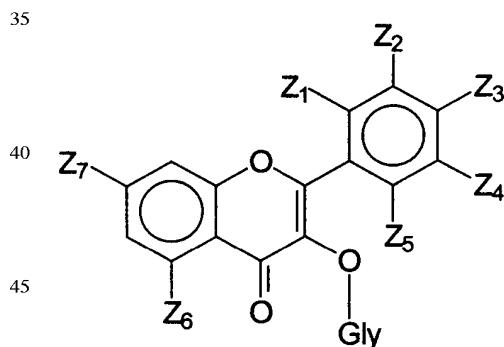
50

65

	OH-Substitutionspositionen							
	3	5	7	8	2'	3'	4'	5'
5 Flavon	-	-	-	-	-	-	-	-
10 Flavonol	+	-	-	-	-	-	-	-
15 Chrysin	-	+	+	-	-	-	-	-
20 Galangin	+	+	+	-	-	-	-	-
25 Apigenin	-	+	+	-	-	-	+	-
30 Fisetin	+	-	+	-	-	+	+	-
Luteolin	-	+	+	-	-	+	+	-
Kämpferol	+	+	+	-	-	-	+	-
Quercetin	+	+	+	-	-	+	+	-
Morin	+	+	+	-	+	-	+	-
Robinetin	+	-	+	-	-	+	+	+
Gossypetin	+	+	+	+	-	+	+	-
Myricetin	+	+	+	-	-	+	+	+

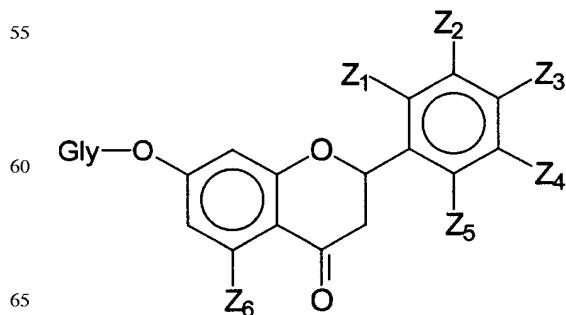
[0046] In der Natur kommen Flavone in der Regel in glycosidierter Form vor.

[0047] Erfundungsgemäß werden die Flavonoide bevorzugt gewählt gewählt aus der Gruppe der Substanzen der generischen Strukturformel



wobei Z₁ bis Z₇ unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe H, OH, Alkoxy- sowie Hydroxyalkoxy-, wobei die Alkoxy- bzw. Hydroxyalkoxygruppen verzweigt und unverzweigt sein und 1 bis 18 C-Atome aufweisen können, und wobei Gly gewählt wird aus der Gruppe der Mono- und Oligoglycosidreste.

[0048] Erfundungsgemäß können die Flavonoide aber auch vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der Substanzen der generischen Strukturformel



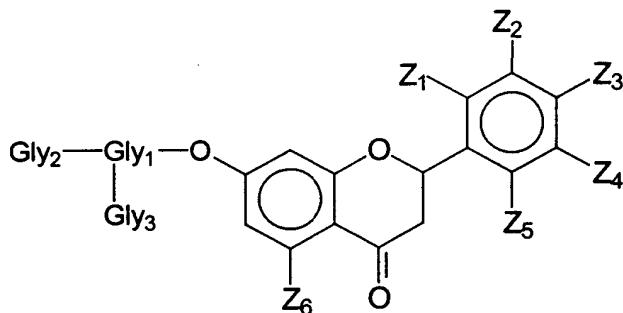
wobei Z₁ bis Z₆ unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe H, OH, Alkoxy- sowie Hydroxyalkoxy-, wobei

DE 101 31 796 A 1

die Alkoxy- bzw. Hydroxyalkoxygruppen verzweigt und unverzweigt sein und 1 bis 18 C-Atome aufweisen können, und wobei Gly gewählt wird aus der Gruppe der Mono- und Oligoglycosidreste.

[0049] Bevorzugt können solche Strukturen gewählt werden aus der Gruppe der Substanzen der generischen Strukturformel

5



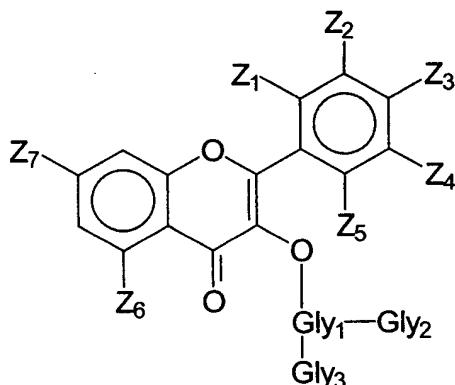
wobei Gly₁, Gly₂ und Gly₃ unabhängig voneinander Monoglycosidreste oder darstellen. Gly₂ bzw. Gly₃ können auch einzeln oder gemeinsam Absättigungen durch Wasserstoffatome darstellen.

[0050] Bevorzugt werden Gly₁, Gly₂ und Gly₃ unabhängig voneinander gewählt aus der Gruppe der Hexosylreste, insbesondere der Rhamnosylreste und Glucosylreste. Aber auch andere Hexosylreste, beispielsweise Allosyl, Altrosyl, Galactosyl, Gulosyl, Idosyl, Mannosyl und Talosyl sind gegebenenfalls vorteilhaft zu verwenden. Es kann auch erfindungsgemäß vorteilhaft sein, Pentosylreste zu verwenden.

[0051] Vorteilhaft werden Z₁ bis Z₅ unabhängig voneinander gewählt aus der Gruppe H, OH, Methoxy-, Ethoxy- sowie 2-Hydroxyethoxy-, und die Flavonglycoside haben die Struktur

20

25

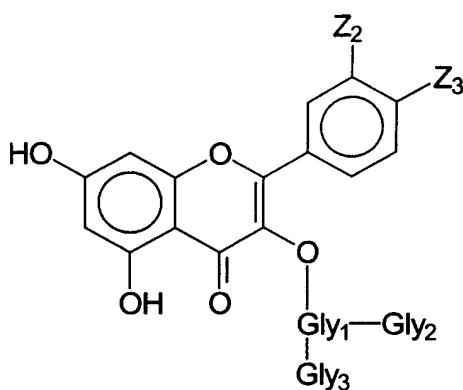


[0052] Besonders vorteilhaft werden die erfindungsgemäßen Flavonglycoside aus der Gruppe, welche durch die folgende Struktur wiedergegeben werden:

30

35

40



wobei Gly₁, Gly₂ und Gly₃ unabhängig voneinander Monoglycosidreste oder darstellen. Gly₂ bzw. Gly₃ können auch einzeln oder gemeinsam Absättigungen durch Wasserstoffatome darstellen.

[0053] Bevorzugt werden Gly₁, Gly₂ und Gly₃ unabhängig voneinander gewählt aus der Gruppe der Hexosylreste, insbesondere der Rhamnosylreste und Glucosylreste. Aber auch andere Hexosylreste, beispielsweise Allosyl, Altrosyl, Galactosyl, Gulosyl, Idosyl, Mannosyl und Talosyl sind gegebenenfalls vorteilhaft zu verwenden. Es kann auch erfindungsgemäß vorteilhaft sein, Pentosylreste zu verwenden.

60

65

[0054] Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist, das oder die Flavonglycoside zu wählen aus der Gruppe α -Glucosylrutin, α -Glucosylmyricetin, α -Glucosylisoquercitrin, α -Glucosylisoquercetin und α -Glucosylquercitrin.

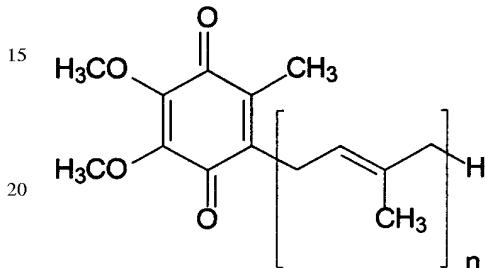
DE 101 31 796 A 1

[0055] Erfindungsgemäß besonders bevorzugt ist α -Glucosylrutin.

[0056] Erfindungsgemäß vorteilhaft sind auch Naringin (Aurantün, Naringenin-7-rhamnoglucosid), Hesperidin (3',5,7-Trihydroxy-4'-methoxyflavanon-7-rutinosid, Hesperidosid, Hesperetin-7-O-rutinosid). Rutin (3,3',4',5,7-Penta-hydroxyflyvon-3-rutinosid, Quercetin-3-rutinosid, Sophorin, Birutan, Rutablon, Taurutin, Phytomelin, Melin), Troxerutin (3,5-Dihydroxy-3',4,7-tris(2-hydroxyethoxy)-flavon-3-(6-O-(6-deoxy- α -L-mannopyranosyl)- β -D-glucopyranosid)), Monoxerutin (3,3',4',5-Tetrahydroxy-7-(2-hydroxyethoxy)-flavon-3-(6-O-(6-deoxy- α -L-mannopyranosyl)- β -D-glucopyranosid), Dihydrorobinetin (3,3',4',5',7-Pentahydroxyflavanon), Taxifolin (3,3',4',5,7-Pentahydroxyflavanon), Eriodictyol-7-glucosid (3',4',5,7-Tetrahydroxyflavanon-7-glucosid), Flavanomarein (3',4',7,8-Tetrahydroxyflavanon-7-glucosid) und Isoquerctin (3,3',4',5,7-Pentahydroxyflavanon-3-(β -D-Glucopyranosid).

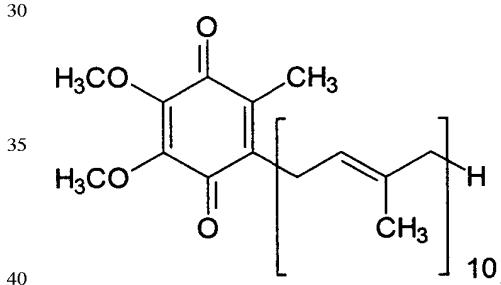
[0057] Vorteilhaft ist es auch, den oder die weiteren Wirkstoffe aus der Gruppe der Ubichinone und Plastochinone zu wählen.

[0058] Ubichinone zeichnen sich durch die Strukturformel

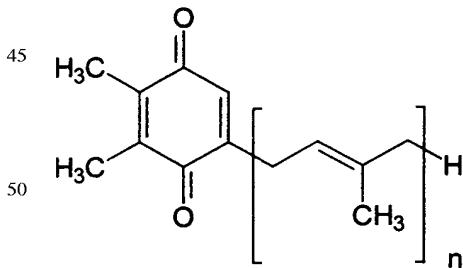


25 aus und stellen die am weitesten verbreiteten und damit am besten untersuchten Biochinone dar. Ubichinone werden je nach Zahl der in der Seitenkette verknüpften Isopren-Einheiten als Q-1, Q-2, Q-3 usw. oder nach Anzahl der C-Atome als U-5, U-10, U-15 usw. bezeichnet. Sie treten bevorzugt mit bestimmten Kettenlängen auf, z. B. in einigen Mikroorganismen und Hefen mit $n = 6$. Bei den meisten Säugetieren einschließlich des Menschen überwiegt Q10.

[0059] Besonders vorteilhaft ist Coenzym Q10, welches durch folgende Strukturformel gekennzeichnet ist:

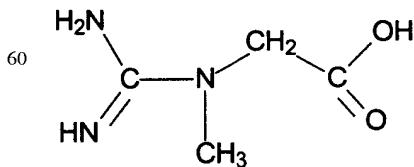


[0060] Plastochinone weisen die allgemeine Strukturformel



55 auf. Plastochinone unterscheiden sich in der Anzahl n der Isopren-Reste und werden entsprechend bezeichnet, z. B. PQ-9 ($n = 9$). Ferner existieren andere Plastochinone mit unterschiedlichen Substituenten am Chinon-Ring.

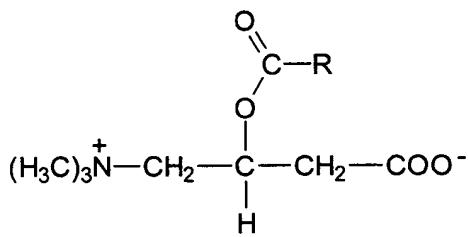
[0061] Auch Kreatin und/oder Kreatinderivate sind bevorzugte weitere Wirkstoffe im Sinne der vorliegenden Erfahrung. Kreatin zeichnet sich durch folgende Struktur aus:



65 [0062] Bevorzugte Derivate sind Kreatinphosphat sowie Kreatinsulfat, Kreatinacetat, Kreatinascorbat und die an der Carboxylgruppe mit mono- oder polyfunktionalen Alkoholen veresterten Derivate.

[0063] Ein weiterer vorteilhafter weiterer Wirkstoff ist L-Carnitin [3-Hydroxy-4-(trimethylammonio)-buttersäurebe-

tain]. Auch Acyl-Carnitine, welche gewählt aus der Gruppe der Substanzen der folgenden allgemeinen Strukturformel



5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

wobei R gewählt wird aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylreste mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen sind vorteilhafte Wirkstoffe im Sinne der vorliegenden Erfindung. Bevorzugt sind Propionylcarnitin und insbesondere Acetylcarnitin. Beide Enantiomere (D- und L-Form) sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden. [0064] Es kann auch von Vorteil sein, beliebige Enantiomerengemische, beispielsweise ein Racemat aus D- und L-Form, zu verwenden.

[0065] Weitere vorteilhafte weiteren Wirkstoffe sind Sericosid, Pyridoxol, Vitamin K, Biotin und Aromastoffe.

[0066] Die Liste der genannten Wirkstoffe bzw. Wirkstoffkombinationen, die in den erfundungsgemäßen Zubereitungen in Kombination mit Cardiolipin verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein. Die Wirkstoffe können einzelnen oder in beliebigen Kombinationen miteinander verwendet werden.

[0067] Der Gehalt dieser Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) wird vorteilhaft aus dem Bereich von 0,0001 bis 30 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

[0068] Es ist auch vorteilhaft, wenngleich selbstverständlich nicht zwingend, das Cardiolipin in verkapselter Form dazureichen, z. B. in Kollagenmatrices und anderen üblichen Verkapselungsmaterialien, z. B. als Celluloseverkapselungen, in Gelatine, Wachsmatrizes oder liposomal verkapselt. Insbesondere Wachsmatrices wie sie in der DE-OS 43 08 282 beschrieben werden, haben sich als günstig herausgestellt. Besonders vorteilhafte Verkapselungsformen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner Cyclodextrinkomplexe von Cardiolipin.

[0069] Ferner kann es von Vorteil sein, den erfundungsgemäßen Wirkstoff z. B. als sogenannte solid lipid nanoparticles mit Hilfe von aufgeschmolzenen Wachsen zu verkapseln, die unter anderem, aber nicht ausschließlich, gewählt sein können aus der Gruppe der Esterwachse, Triglyceridwachse oder Kohlenwasserstoffwachse. Weiterhin kann es von Vorteil sein die erfundungsgemäßen Wirkstoffe in Polymere zu verkapseln, z. B. in Partikel auf Basis hochvernetzter Polymethacrylate und/oder Celluloseacetate und/oder als Core/Shell-Partikel mit einer Hülle aus Poly(oxymethylurea), Nylon, Polyamide, Polyurethan, Polyester, Gelatine und Polyolefine.

[0070] Die Prophylaxe bzw. die kosmetische oder dermatologische Behandlung mit dem erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. mit den kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfundungsgemäß verwendetem Wirkstoff erfolgt in der üblichen Weise, und zwar dergestalt, daß der erfundungsgemäß verwendete Wirkstoff bzw. die kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfundungsgemäß verwendetem Wirkstoff auf die betroffenen Hautstellen aufgetragen wird.

[0071] Erfundungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z. B. in Form einer Creme, einer Lotion, einer kosmetischen Milch sind vorteilhaft und enthalten z. B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

[0072] Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, den erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoff in wässrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut und der Haare einzufügen.

[0073] Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insekten repellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

[0074] Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

[0075] Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z. B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

[0076] Es ist dabei ebenfalls von Vorteil, den erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoff als Zusatzstoff zu Zubereitungen zu geben, die bereits andere Wirkstoffe für andere Zwecke enthalten.

[0077] Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcreme, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcreme, Tages- oder Nachtcreme usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfundungsgemäß Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

[0078] Es ist auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, kosmetische und dermatologische Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescremes oder Makeup-Produkten gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet. Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar. Günstig sind ferner kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen.

[0079] Dementsprechend enthalten die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung vorzugsweise neben einem oder mehreren erfundungsgemäß verwendeten Wirkstoffen zusätzlich mindestens eine weitere UV-A- und/oder UV-

B-Filtersubstanz. Die Formulierungen können, obgleich nicht notwendig, gegebenenfalls auch ein oder mehrere organische und/oder anorganische Pigmente als UV-Filtersubstanzen enthalten, welche in der Wasser- und/oder der Ölphase vorliegen können.

[0080] Bevorzugte anorganische Pigmente sind Metalloxide und/oder andere in Wasser schwerlösliche oder unlösliche 5 Metallverbindungen, insbesondere Oxide des Titans (TiO_2), Zinks (ZnO), Eisens (z. B. Fe_2O_3), Zirkoniums (ZrO_2), Siliciums (SiO_2), Mangans (z. B. MnO), Aluminiums (Al_2O_3), Cers (z. B. Ce_2O_3), Mischoxide der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden.

[0081] Solche Pigmente können im Sinne der vorliegenden Erfindung vorteilhaft oberflächlich behandelt ("gecoatet") sein, wobei beispielsweise ein amphiphiler oder hydrophober Charakter gebildet werden bzw. erhalten bleiben soll. 10 Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophoben Schicht versehen werden.

[0082] Erfundungsgemäß vorteilhaft sind z. B. Titandioxidpigmente, die mit Octylsilanol beschichtet sind. Geeignete Titandioxidpartikel sind unter der Handelsbezeichnung T805 bei der Firma Degussa erhältlich. Besonders vorteilhaft sind ferner mit Aluminiumstearat beschichtete TiO_2 -Pigmente, z. B. die unter der Handelsbezeichnung MT 100 T bei der 15 Firma TAYCA erhältlichen.

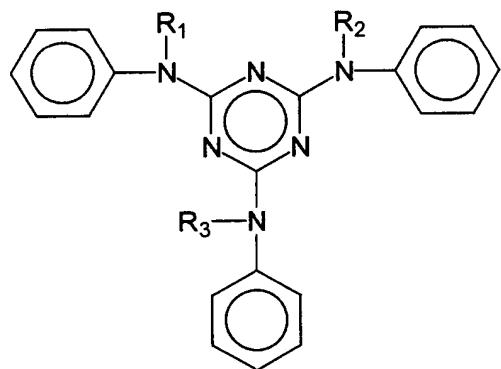
[0083] Eine weitere vorteilhafte Beschichtung der anorganischen Pigmente besteht aus Dimethylpolysiloxan (auch: Dimethicon), einem Gemisch vollmethylierter, linearer Siloxanpolymere, die endständig mit Trimethylsiloxy-Einheiten blockiert sind. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Zinkoxid-Pigmente, die auf diese Weise beschichtet werden. 20 [0084] Vorteilhaft ist ferner eine Beschichtung der anorganischen Pigmente mit einem Gemisch aus Dimethylpolysiloxan, insbesondere Dimethylpolysiloxan mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 350 Dimethylsiloxan-Einheiten, und Silicagel, welches auch als Simethicone bezeichnet wird. Es ist insbesondere von Vorteil, wenn die anorganischen Pigmente zusätzlich mit Aluminiumhydroxid bzw. Aluminiumoxidhydrat (auch: Alumina, CAS-Nr.: 1333-84-2) beschichtet sind. Besonders vorteilhaft sind Titandioxide, die mit Simethicone und Alumina beschichtet sind, wobei die 25 Beschichtung auch Wasser enthalten kann. Ein Beispiel hierfür ist das unter dem Handelsnamen Eusolex T2000 bei der Firma Merck erhältliche Titandioxid.

[0085] Vorteilhaftes organisches Pigment im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol) [INCI: Bisoctyltriazol], welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist. 30 [0086] Vorteilhaft enthalten erfundungsgemäße Zubereitungen Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

[0087] Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dibenzoylmethanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr. 70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird. 35 [0088] Weitere vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen sind die Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und ihre Salze, besonders die entsprechenden Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze, insbesondere das Phenyl-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz mit der INCI-Bezeichnung Bisimidazylate, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Neo Heliolan AP bei Haarmann & Reimer erhältlich ist. 40 [0089] Ferner vorteilhaft sind das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (besonders die entsprechenden 10-Sulfato-verbindingen, insbesondere das entsprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), das auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) bezeichnet wird.

[0090] Vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner sogenannte Breitbandfilter, d. h. Filtersubstanzen, die sowohl UV-A- als auch UV-B-Strahlung absorbieren. 45 [0091] Vorteilhafte Breitbandfilter oder UV-B-Filtersubstanzen sind beispielsweise Bis-Resorcinyltriazinderivate. Insbesondere bevorzugt sind das 2,4-Bis-{[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (INCI: Aniso Triazin), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® S bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich 50 ist.

[0092] Besonders vorteilhafte Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, die sich durch einen hohen bzw. sehr hohen UV-A-Schutz auszeichnen, enthalten bevorzugt mehrere UV-A- und/oder Breitbandfilter, insbesondere Dibenzoylmethanderivate [beispielsweise das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan], Benzotriazolderivate [beispielsweise das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol)], Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und/oder ihre Salze, das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und/oder dessen Salze und/oder das 2,4-Bis-{[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxyl]-phenyl}-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen miteinander. Auch andere UV-Filtersubstanzen, welche das Strukturmotiv

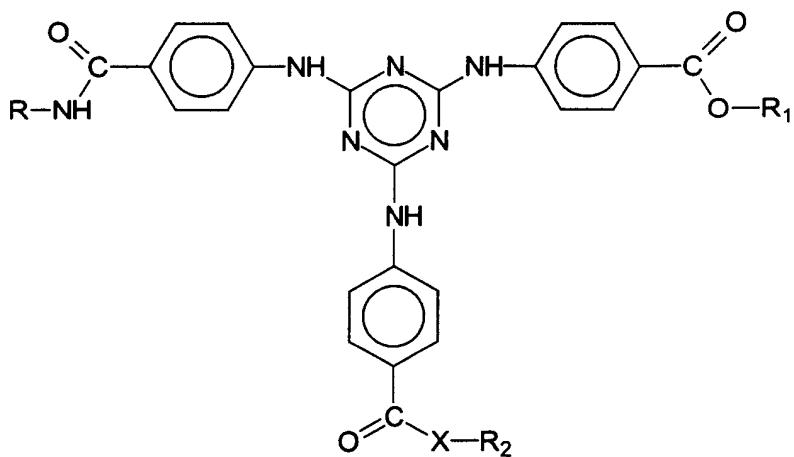


5

10

15

aufweisen, sind vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung, beispielsweise die in der Europäischen Offenlegungsschrift EP 570 838 A1 beschriebenen s-Triazinderivate, deren chemische Struktur durch die generische Formel



20

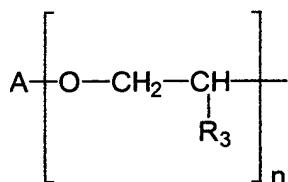
25

30

35

wiedergegeben wird, wobei
 R einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, darstellt, X ein Sauerstoffatom oder eine NH-Gruppe darstellt,
 R₁ einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel

40



45

50

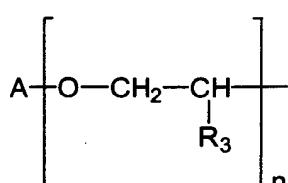
bedeutet, in welcher
 A einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen,
 R₃ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,

55

n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,

R₂ einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, darstellt, wenn X die NH-Gruppe darstellt, und
 einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel

60



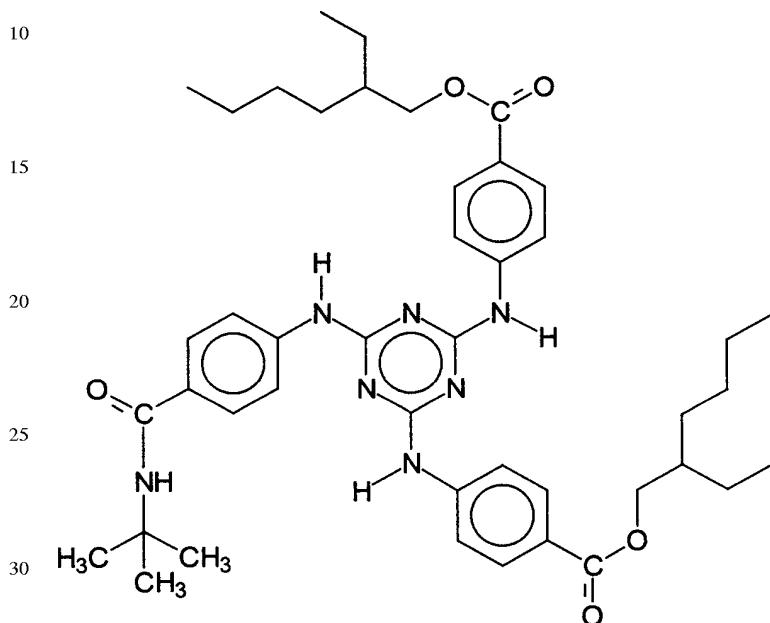
65

bedeutet, in welcher

A einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄-Alkylgruppen,
R₃ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,

5 n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,
wenn X ein Sauerstoffatom darstellt.

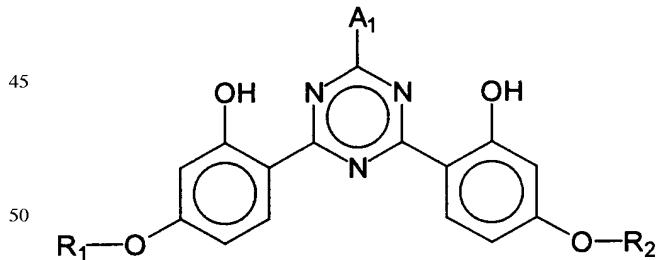
[0093] Besonders bevorzugte UV-Filtersubstanz im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner ein unsymmetrisch substituiertes s-Triazin, dessen chemische Struktur durch die Formel



wiedergegeben wird, welches im Folgenden auch als Dioctylbutylamidotriazon (INCI: Dioctylbutamidotriazole) bezeichnet wird und unter der Handelsbezeichnung UVASORB HEB bei Sigma 3 V erhältlich ist.

[0094] Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist auch ein symmetrisch substituiertes s-Triazin, das 4,4',4''-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriamino)-tris-benzoësäure-tris(2-ethylhexylester), synonym: 2,4,6-Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-1,3,5-triazin (INCI: Octyl Triazole), welches von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung UVINUL® T 150 vertrieben wird.

40 [0095] Auch in der Europäischen Offenlegungsschrift 775 698 werden bevorzugt einzusetzende Bis-Resorcincyltriazin-derivate beschrieben, deren chemische Struktur durch die generische Formel



wiedergegeben wird, wobei R₁, R₂ und A₁ verschiedenste organische Reste repräsentieren.

[0096] Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner das 2,4-Bis-[{4-(3-sulfonato)-2-hydroxy-propyloxy}-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin Natriumsalz, das 2,4-Bis-[{4-(3-(2-Propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[{4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-[4-(2-methoxyethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[{4-(3-(2-propyloxy)-2-hydroxypropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-[4-(2-ethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[{4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(1-methyl-pyrrol-2-yl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[{4-tris(trimethylsiloxy-silylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[{4-(2"-methylpropenoxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin und das 2,4-Bis-[{4-(1',1',1',3',5',5',5'-Heptamethylsiloxy-2"-methylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin.

[0097] Ein vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylenbis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

[0098] Vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner das 2-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-methyl-6-[2-methyl-3-[1,3,3,3-tetramethyl-1-[(trimethylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-phenol (CAS-Nr.: 155633-54-8) mit der INCI-Bezeichnung Drometrizole Trisiloxane.

DE 101 31 796 A 1

[0099] Die UV-B- und/oder Breitband-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Vorteilhafte öllösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- 2,4,6-Trianilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylenbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon
- sowie an Polymere gebundene UV-Filter.

[0100] Vorteilhafte wasserlösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

[0101] Eine weiterere erfundungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lichtschutzfiltersubstanz ist das Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen), welches von BASF unter der Bezeichnung Uvinul® N 539 erhältlich ist.

[0102] Es kann auch von erheblichem Vorteil sein, polymergebundene oder polymere UV-Filtersubstanzen in Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfundung zu verwenden, insbesondere solche, wie sie in der WO-A-92/20690 beschrieben werden.

[0103] Ferner kann es gegebenenfalls von Vorteil sein, erfundungsgemäß weitere UV-A- und/oder UV-B-Filter in kosmetische oder dermatologische Zubereitungen einzuarbeiten, beispielsweise bestimmte Salicylsäurederivate wie 4-Isopropylbenzylsalicylat, 2-Ethylhexylsalicylat (= Octylsalicylat), Homomenthylsalicylat.

[0104] Die Liste der genannten UV-Filter, die im Sinne der vorliegenden Erfundung eingesetzt werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

[0105] Vorteilhaft enthalten die erfundungsgemäßen Zubereitungen die Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, in einer Gesamtmenge von z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

[0106] Die erfundungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

[0107] Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung im Sinne der vorliegenden Erfundung eine Lösung oder Emulsion oder Dispersion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:

- Wasser oder wäßrige Lösungen
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

[0108] Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

[0109] Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfundung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyleoleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyoleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

[0110] Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten

DE 101 31 796 A 1

oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, 5 Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

[0111] Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

[0112] Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C_{12–15}-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

[0113] Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C_{12–15}-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C_{12–15}-Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C_{12–15}-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

[0114] Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

[0115] Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

[0116] Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

[0117] Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

[0118] Die wässrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carboole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

[0119] Erfindungsgemäß verwendete Gele enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wässrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugweise ein Polyacrylat ist.

[0120] Feste Stifte enthalten z. B. natürliche oder synthetische Wachse, Fettalkohole oder Fettsäureester.

[0121] Übliche Grundstoffe, welche für die Verwendung als kosmetische Stifte im Sinne der vorliegenden Erfindung geeignet sind, sind flüssige Öle (z. B. Paraffinöle, Ricinusöl, Isopropylmyristat), halbfeste Bestandteile (z. B. Vaseline, 40 Lanolin), feste Bestandteile (z. B. Bienenwachs, Ceresin und Mikrokristalline Wachse bzw. Ozokerit) sowie hochschmelzende Wachse (z. B. Carnaubawachs, Candelillawachs).

[0122] Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

[0123] Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

[0124] Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt am erfindungsgemäßen Wirkstoff und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

[0125] Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen:

DE 101 31 796 A 1

Beispiele

1. PIT-Emulsionen

	1	2	3	4	5
Glycerinmonostearat SE	0,50		3,00	2,00	4,00
Ceteareth-12		5,00		1,00	1,50
Ceteareth-20				2,00	
Ceteareth-30	5,00		1,00		
Stearyl Alkohol			3,00		0,50
Cetyl Alkohol	2,50	1,00		1,50	
Ethylhexyl Methoxycinnamat				5,00	8,00
Aniso Triazin		1,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethan			2,00		
Dioctyl Butamidotriazon	1,00	2,00		2,00	
Ethylhexyl Triazon	4,00		3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Camphor		4,00			2,00
Octocrylen		4,00			2,50
Bisimidazylat			0,50		1,50
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	
C ₁₂₋₁₅ Alkyl Benzoat		2,50			5,00
Titandioxid	0,50	1,00		3,00	2,00
Zinkoxid	2,00		3,00	0,50	1,00
Dicaprylyl Ether			3,50		
Butylen Glycol Dicaprylat/Dicaprat	5,00			6,00	
Dicaprylyl Carbonat			6,00		2,00
Dimethicon		0,50	1,00		
Phenyltrimethicon	2,00			0,50	0,50
Shea Butter		2,00			0,50
PVP Hexadecen Copolymer	0,50			0,50	1,00
Glycerin	3,00	7,50	5,00	7,50	2,50
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00
Cardiolipin	0,10	0,50	1,50	0,20	0,10

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

Alpha Glucosylrutin	0,10		0,20		
DMDM Hydantoin	0,60		0,40	0,20	
Koncyl – L ®		0,20			0,15
Methylparaben		0,50	0,25	0,15	
Phenoxyethanol	0,50	0,40		1,00	0,60
Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100				

2. Beispiele O/W Cremes

Beispiele	1	2	3	4	5
Glycerylstearatcitrat			2,00		2,00
Glycerylstearat SE	4,00	3,00			
PEG-40-Stearat	1,00				
Polyglyceryl-3-Methylglucose Distearat				3,00	
Sorbitanstearat					2,00
Stearinsäure		1,00			
Ceteth-20					
Stearylalkohol			5,00		
Cetylalkohol	3,00	2,00		3,00	
Cetylstearylalkohol					2,00
Caprylic/Capric Triglycerid	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Octyldodecanol			2,00		2,00
Dicaprylether		4,00		2,00	1,00
Mineral Oil	5,00	2,00		3,00	
TiO ₂			1,00		
4-Methylbenzylidene Camphor			1,00		
Butyl Methoxydibenzolymethane			0,50		
Cardiolipin	0,20	0,50	0,10	1,00	0,30

Tocopherol	0,1				0,20
Biotin			0,05		
Trisodium EDTA	0,1		0,10	0,1	
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Carbomer	3,00	0,1		0,1	0,1
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Butylene Glycol		3,00			
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Aqua	ad 100				

5

10

15

20

Beispiele	6	7	8	9	10
Glycerylstearatcitrat		2,00	2,00		
Glycerylstearat SE	5,00				
Stearinsäure				2,50	3,50
Stearyl Alkohol	2,00				
Cetyl Alkohol				3,00	4,50
Cetylstearylalkohol		3,00	1,00		0,50
C ₁₂₋₁₅ Alkylbenzoat		2,00	3,00		
Caprylic/Capric Triglycerid	2,00				
Octyldodecanol	2,00	2,00		4,00	6,00
Mineral Oil		4,00	2,00		
Cyclomethicone				0,50	2,00
Dimethicone	2,00				
TiO ₂	2,00				
4-Methylbenzylidene Camphor	1,00				1,00
Butyl Methoxydibenzolymethane	0,50				0,50
Cardiolipin	0,20	0,70	0,25	2,00	0,40
Tocopherol					0,05
Trisodium EDTA			0,20		0,20
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.

25

30

35

40

45

50

55

60

65

5	Xanthan Gum			0,20		
10	Carbomer	0,15	0,1		0,05	0,05
15	Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
	Glycerin	3,00		3,00	5,00	3,00
	Butylene Glycol		3,00			
	Alcohol Denat.		3,00		3,00	
	Parfuem	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
	Aqua	ad 100				

3. Beispiele W/O Emulsionen

		1	2	3	4	5
20	Cetyltrimonium Copolyol		2,50		4,00	
25	Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00				4,50
30	PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
35	Ethylhexyl Methoxycinnamate		8,00		5,00	4,00
40	Aniso Triazine	2,00	2,50		2,00	2,50
45	Butyl Methoxydibenzoylmethane			2,00	1,00	
50	Diocetyl Butamidotriazone	3,00	1,00			3,00
55	Ethylhexyl Triazone			3,00	4,00	
60	4-Methylbenzylidene Camphor		2,00		4,00	2,00
	Octocrylene	7,00	2,50	4,00		2,50
	Diocetylbutamidotriazone	1,00			2,00	
	Bisimidazylate	1,00	2,00	0,50		
	Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid	0,50			3,00	2,00
	Titandioxid		2,00	1,50		3,00
	Zinkoxid	3,00	1,00	2,00	0,50	
	Mineralöl			10,0		8,00
	C12-15 Alkyl Benzoate				9,00	
	Dicaprylyl Ether	10,00				7,00
	Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate			2,00	8,00	4,00
	Dicaprylyl Carbonate	5,00		6,00		

DE 101 31 796 A 1

Dimethicone		4,00	1,00	5,00	
Cyclomethicone	2,00	25,00			2,00
Shea Butter			3,00		
PVP Hexadecene Copolymer	0,50			0,50	1,00
Butylene Glycol					
Octoxyglycerin		0,30	1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja		1,00	1,50		
MgSO ₄	1,00	0,50		0,50	
MgCl ₂			1,00		0,70
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00
Cardiolipin	0,10	0,60	1,50	1,00	0,80
Trisodium EDTA					
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Methylparaben	0,50		0,25	0,15	
Phenoxyethanol	0,50	0,40		1,00	0,60
Ethanol	3,00		1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100				

	6	7	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	4,00	5,00	40
Lanolin alcohol	0,50	1,50	
Isohexadecane	1,00	2,00	45
Myristyl Myristate	0,50	1,50	
Cera Microcristallina + Paraffinum Liquidum	1,00	2,00	50
Butyl Methoxydibenzoylmethane	0,50	1,50	
4-Methylbenzylidene Camphor	1,00	3,00	55
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprante	4,00	5,00	
Shea Butter		0,50	
Butylene Glycol		6,00	60

5	Octoxyglycerin		3,00
10	Glycerin	5,00	
15	Vitamin E Acetat	0,50	1,00
20	Cardiolipin	0,20	0,25
	Trisodium EDTA	0,20	0,20
	Methylparaben	q.s.	q.s.
	Phenoxyethanol	q.s.	q.s.
	Ethanol		3,00
	Parfum	q.s.	q.s.
	Wasser	ad 100	ad 100

25

30

35

40

45

50

55

60

65

DE 101 31 796 A 1

4. Beispiele Hydrodispersionen

	1	2	3	4	5
Ceteareth-20	1,00			0,5	
Cetyl Alkohol			1,00		
Sodium Carbomer		0,20		0,30	
Acrylates/C10-30 Alkyl Acrylate Cross-polymer	0,50		0,40	0,10	0,10
Xanthan Gummi		0,30	0,15		0,50
Ethylhexyl Methoxycinnamate				5,00	8,00
Aniso Triazine		1,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethane	1,00		2,00		
Diocetyl Butamidotriazon		2,00		2,00	1,00
Ethylhexyl Triazole	4,00		3,00	4,00	
4-Methylbenzylidene Camphor	4,00	4,00			2,00
Octocrylene		4,00	4,00		2,50
Diocetylbutamidotriazole	1,00			2,00	
Bisimidazylate	1,00		0,50		2,00
Phenylbenzimidazol SulfonSÄURE	0,50			3,00	
Titandioxid	0,50		2,00	3,00	1,00
Zinkoxid	0,50	1,00	3,00		2,00
C ₁₂₋₁₅ AlkylBenzoat	2,00	2,50			
Dicaprylyl Ether		4,00			
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprante	4,00		2,00	6,00	
Dicaprylyl Carbonat		2,00	6,00		
Dimethicone		0,50	1,00		
Phenyltrimethicone	2,00			0,50	2,00
Shea Butter		2,00			
PVP Hexadecene Copolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin			1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja			1,50		
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

DE 101 31 796 A 1

5	Cardiolipin	0,15	0,60	1,50	1,00	0,80
10	DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
15	Koncyl - L ®	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
20	Methylparaben	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
25	Phenoxyethanol	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
30	Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
35	Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
40	Wasser	ad 100				

5. Beispiel (Gelcreme)

		Massengehalt (%)
20	Acrylates/C ₁₀₋₃₀ Alkyl Acrylate Crosspolymer	0,40
25	Carbomer	0,20
30	Xanthan Gum	0,10
35	Cetearyl Alkohol	3,00
40	C ₁₂₋₁₅ Alkylbenzoat	4,00
45	Caprylic/Capric Triglyceride	3,00
50	Cyclomethicone	5,00
55	Dimeticone	1,00
60	Cardiolipin	0,20
65	Glycerin	3,00
70	Natriumhydroxid	q.s.
75	Konservierung	q.s.
80	Parfum	q.s.
85	Wasser, demineralisiert	ad 100,0
90	pH-Wert eingestellt auf 6,0	

6. Beispiel (WIO-Creme)

		Massengehalt (%)
40	Lameform TGI	3,50
45	Glycerin	3,00
50	Dehymuls PGPH	3,50
55	Cardiolipin	0,50
60	Konservierungsmittel	q.s.
65	Parfum	q.s.
70	Wasser, demin.	ad 100,0
75	Magnesiumsulfat	0,6
80	Isopropylstearat	2,0
85	Caprylyl Ether	8,0
90	Cetearylisononanoat	6,0

7. Beispiel (W/O/W-Creme)

		Massengehalt (%)
60	Glycerylstearat	3,00
65	PEG-100 Stearat	0,75
70	Behenylalkohol	2,00
75	Caprylic/Capric Triglyceride	8,00
80	Oetyldecanoat	5,00
85	C ₁₂₋₁₅ Alkylbenzoat	3,00
90	Cardiolipin	1,00
95	Magnesium Sulfat (MgSO ₄)	0,80
100	EDTA	0,10
105	Konservierung	q.s.

Parfum
Wasser, demineralisiert
pH-Wert eingestellt auf 6,0

Massengehalt (%)

q.s.
ad 100,0

5

Patentansprüche

1. Verwendung von Cardiolipin in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung, Pflege und Prophylaxe von degenerativen Hauterscheinungen, sensibler Haut und/oder zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome einer negativen Veränderung der physiologischen Homeostase der gesunden Haut. 10
2. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die degenerativen Hauterscheinungen ein oder mehrere Erscheinungsbilder aus der folgenden Gruppe darstellen:
 - Falten und/oder Fältchen,
 - Haut- und/oder Gewebeerschlaffung,
 - Störungen der Regeneration der Haut und der Hautanhangsgebilde
 - Durchblutungsstörungen der Haut,
 - sensible Haut,
 - Juckreiz,
 - Stressempfindlichkeit der Haut,
 - entzündliche und empfindliche Hautzustände
 - trockene Hautzustände
 - atopisches Ekzem
 - Psoriasis.
3. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die Hautveränderungen ein oder mehrere Erscheinungsbilder betreffen aus der folgenden Gruppe darstellen:
 - degenerative Erscheinungen der Haut (Hauterschlaffung, Elastizitätsverlust, Altersflecken, Teleangiektasien, Störung der Osmolytbalance, des natürlichen Haut pH-Werts sowie Schwund der epidermalen und dermalen Zellachichten, der Bestandteile des Bindegewebes, der Retezapfen und Kapillargefäße der Haut) und/oder der Hautanhangsgebilde,
 - umweltbedingte (durch Rauchen, Smog, reaktive Sauerstoffspezies, freie Radikale und dergleichen verursachte) negative Veränderungen der Haut und der Hautanhangsgebilde,
 - defizitäre, sensitive oder hypoaktive Hautzuständen oder defizitäre, sensitive oder hypoaktive Zustände von Hautanhangsgebilden (Talg- u. Schweißdrüsen),
 - verringelter Hautdicke,
 - Hauterschlaffung und Hautermüdung,
 - Störungen des normalen Haut-pH-Werts und der Osmolytbalance,
 - Pigmentierungsstörungen,
 - Juckreiz,
 - Hornschichtbarrierestörungen,
 - Veränderungen des transepidermalen Wasserverlustes und des normalen Feuchtigkeitsgehaltes der Haut,
 - Veränderungen der normalen Lipidperoxidationen,
 - Veränderung des Ceramid-, Lipid- und Energiestoffwechsels der gesunden Haut,
 - Haarausfall, für verbessertes Haarwachstum und/oder bei Störungen in der Strukturausbildung von Haaren,
 - Abweichungen von der normalen Zell-Zell-Kommunikation in der Haut,
 - Veränderungen der normalen Fibroblasten- und Keratinozytenproliferation,
 - Veränderungen der normalen Fibroblasten- und Keratinozytendifferenzierung,
 - entzündliche Hautzuständen sowie atopischem Ekzem, seborrhoischem Ekzem, polymorpher Lichtdermatose, Psoriasis, Vitiligo,
 - Veränderungen zur Beruhigung von empfindlicher oder gereizter Haut,
 - Veränderungen zur Aufrechterhaltung der normalen Kollagen-, Hyaluronsäure-, Elastin- und Glycosaminoglycan-Homeostase,
 - Veränderungen zur Stimulation der Östrogen-Synthetase,
 - bei gesteigerter Aktivierung proteolytischer Enzyme in der Haut, wie Metalloproteinasen,
 - Veränderungen zur Stimulation der intrazellulären DNA-Synthese, bei defizitären oder hypoaktiven Hautzuständen,
 - Wundheilungsstörungen,
 - Veränderungen zur Steigerung der Zellerneuerung und Regeneration der Haut,
 - Veränderungen zur Verminderung der Produktion von Sebum,
 - Veränderungen zur Verhinderung der Bildung und zur Entfernung von Comedonen und/oder zur Einstellung einer normalen Sebumhomeostase,
 - Veränderungen zur Verhinderung oder Beseitigung von seborrhoischen Erscheinungen,
 - Veränderungen zur Prophylaxe und Behandlung bei fettigem Haar, aber auch bei Kopfschuppen,
 - Veränderungen zur Steigerung der hauteigenen Schutz- und Reparaturmechanismen (dysfunktionelle Enzyme, DNA, Lipide, Proteine),
 - Veränderungen zur Vor- und Nachbehandlung bei topischer Anwendung von Laser- und Abschleifbehandlungen, die der Reduzierung von Hautfalten und Narben dienen, um den resultierenden Hautreizungen entgegenzuwirken und die Regenerationsprozesse in der verletzten Haut zu fördern.
4. Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an Cardiolipin.

DE 101 31 796 A 1

5. Verwendung nach Anspruch 1 oder Zubereitung nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Cardiolipin in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,0005 bis 50,0 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20,0 Gew.-%, gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

5 6. Verwendung nach Anspruch 1 oder Zubereitung nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Cardiolipin in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,02 bis 10,0 Gew.-%, bevorzugt von 0,02 bis 5,0 Gew.-%, besonders vorteilhaft von 0,5 bis 3,0 Gew.-%, gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

10 7. Verwendung nach Anspruch 1 oder Zubereitung nach Anspruch 3, wobei die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen sich durch einen zusätzlichen Gehalt an einem oder mehreren der weiteren Wirkstoffen auszeichnen.

15 8. Verwendung oder Zubereitung nach Anspruch 6 dadurch gekennzeichnet, daß die weiteren Wirkstoffe aus der Gruppe: alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosylrutin, Carnitin, Camosin, Osmolyte, Klee-Extrakt, Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt gewählt werden.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65